

ANTI-INFLAMMATORY DRUG

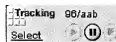
Patent number: JP1163125
Publication date: 1989-06-27
Inventor: MORIKAWA YOSHIHIRO; NAKAMURA TETSUJI;
TAKASU EMIKO; SOGO YUKIO; AHIKO KENKICHI;
SHUKKE SAKANORI
Applicant: SHISEIDO CO LTD; SNOW BRAND MILK PROD CO
LTD
Classification:
- international: **A61K8/00; A61K8/60; A61K8/64; A61K8/72; A61K8/73;
A61K8/96; A61K8/98; A61K31/195; A61K31/70;
A61K38/00; A61P17/00; A61P29/00; A61Q1/00;
A61Q1/04; A61Q5/00; A61Q7/00; A61Q19/00;
A61K8/00; A61K8/30; A61K8/72; A61K8/96;
A61K31/185; A61K31/70; A61K38/00; A61P17/00;
A61P29/00; A61Q1/00; A61Q1/02; A61Q5/00;
A61Q7/00; A61Q19/00; (IPC1-7): A61K7/00; A61K7/06;
A61K31/195; A61K31/70; A61K37/02**
- european: A61K8/60; A61Q19/00
Application number: JP19870323567 19871221
Priority number(s): JP19870323567 19871221

[Report a data error here](#)

Abstract of JP1163125

PURPOSE:To obtain an anti-inflammatory drug useful for preventing and treating skin diseases, having excellent safety and utility free from irritation and hormone-like side effects, containing a sialic acid and a sialic acid derivative as an active ingredient. **CONSTITUTION:**One or a combination of two or more selected from the group consisting of a sialic acid (e.g., N-acetylneuraminic acid) and a sialic acid derivative (e.g., sialic acid bonded oligosaccharide) is used and pharmaceutically manufactured by a conventional procedure to give the aimed substance. The amount of the substance is 0.0001-50wt.% based on sum of the composition. An external preparation is produced in the dosage form of powder, granule, bulky powder, capsule, syrup, suppository or injection. A dose by internal use and percutaneous administration is 0.001-2.000mg based on 1kg weight daily and administered dividedly 1-several times. Sialic acid and the sialic acid derivative is obtained by extraction from cow's milk, goat milk or human milk.

Data supplied from the *esp@cenet* database - Worldwide

DELPHION**RESEARCH****PRODUCTS****INSIDE DELPHION**[Log Out](#)[Work Files](#)[Saved Searches](#)[My Account](#)Search: [Quick/Number](#) [Boolean](#) [Advanced](#) [Der](#)[En](#)**Derwent Record**View: [Expand Details](#) Go to: [Delphion Integrated View](#)Tools: [Add to Work File](#) [Create new Work File](#)Derwent Title: **Antiinflammatory agent - contg. at least one of sialic acid and sialic acid derivs.**Original Title: ☒ **JP01163125A2: ANTI-INFLAMMATORY DRUG**Assignee: **SHISEIDO CO LTD** Standard company
Other publications from [SHISEIDO CO LTD \(SHIS\)...](#)
SNOW BRAND MILK PROD CO LTD Standard company
Other publications from [SNOW BRAND MILK PROD CO LTD \(SNOW\)...](#)Inventor: **None**Accession/Update: **1989-225642 / 199802**IPC Code: **A61K 38/00 ; A61K 7/00 ; A61K 31/70 ; A61K 37/02 ;**Derwent Classes: **A96; B03; D21; E13;**Manual Codes: **A12-V01** (Medicines, pharmaceuticals) , **B07-A02** (Tetrahydrofuran or pyran) [general] , **B12-D07** (Antiinflammatory) , **D08-B** (Cosmetic preparations [general and others]) , **E07-A02H** (Tetrahydropyran with -O- substituents (not =O))Derwent Abstract: **(JP01163125A)** Antiinflammatory agent contains one or more selected from sialic acid and sialic acid derivs.

The sialic acid and sialic acid derivs. are derived from an extract from milk. The sialic acid-bonded oligosaccharide, sialic acid-bonded protein, sialic acid-bonded lipid and sialic acid salt.

USE/Advantage - The agent may be used continuously for a long period of time with no harmful side-effect (stomach disorder, skin sensitisation, skin disorder, allergy). The agent is extremely safe. LD50 is 1200 mg/kg or more (for intraperitoneal administration) and 1500 mg/kg or more (for peroral administration.).

Family:	PDF Patent	Pub. Date	Derwent Update	Pages	Language	IPC Code
<input checked="" type="checkbox"/>	JP01163125A *	1989-06-27	198931	8	English	A61K 7/00
	Local apps.: JP1987000323567 Filed:1987-12-21 (87JP-0323567)					
	JP02684179B2 =	1997-12-03	199802	7	English	A61K 38/00
	Local apps.: Previous Publ. JP01163125 (JP 1163125)					
	JP1987000323567 Filed:1987-12-21 (87JP-0323567)					

INPADOC Legal Status: **None**

Priority Number:

Application Number	Filed	Original Title
JP1987000323567	1987-12-21	ANTI-INFLAMMATORY DRUG

🔍 Chemical Indexing Codes: [Show chemical indexing codes](#)

🔍 Specific Compound Numbers: [Show specific compounds](#)

🔍 Registry Numbers: 01[M2]:**1704X 1724X 1711X 1714X 89290**
01[M3]:**1704X 1724X 1711X 1714X 89290**

🔍 Polymer Multipunch Codes: [Show polymer multipunch codes](#)

🔍 Related Accessions:

Accession Number	Type	Derwent Update	Derwent Title
C1989-100439	C		
1 item found			

🔍 Title Terms: ANTIINFLAMMATORY AGENT CONTAIN ONE SIALIC ACID SIALIC ACID DERIVATIVE

Pricing Current charges

Derwent Searches: [Boolean](#) | [Accession/Number](#) | [Advanced](#)

Data copyright Thomson Derwent 2003



Copyright © 1997-2008 The Tho

[Subscriptions](#) | [Web Seminars](#) | [Privacy](#) | [Terms & Conditions](#) | [Site Map](#) | [Contact U](#)

⑪ 公開特許公報(A) 平1-163125

⑫ Int. Cl.⁴A 61 K 31/70
7/00

識別記号

ADA

庁内整理番号

7431-4C
Y-7306-4C
F-7306-4C
K-7306-4C

⑬ 公開 平成1年(1989)6月27日

※審査請求 未請求 発明の数 1 (全8頁)

⑭ 発明の名称 抗炎症剤

⑮ 特 願 昭62-323567

⑯ 出 願 昭62(1987)12月21日

- ⑰ 発 明 者 森 川 良 広 東京都中央区銀座7丁目5番5号 株式会社資生堂内
 ⑱ 発 明 者 中 村 哲 治 東京都中央区銀座7丁目5番5号 株式会社資生堂内
 ⑲ 発 明 者 高 須 恵 美 子 東京都中央区銀座7丁目5番5号 株式会社資生堂内
 ⑳ 発 明 者 十 河 幸 夫 神奈川県横浜市内南区井土ヶ谷中町157 ダイハパレス井土ヶ谷703号
 ㉑ 発 明 者 阿 彦 健 吉 東京都小平市花小金井2-688-18
 ㉒ 発 明 者 出 家 栄 記 埼玉県狭山市入間川2丁目23番5号102
 ㉓ 出 願 人 株 式 会 社 資 生 堂 東京都中央区銀座7丁目5番5号
 ㉔ 出 願 人 雪 印 乳 業 株 式 会 社 北海道札幌市東区苗穂町6丁目1番1号

最終頁に続く

明 細 書

1. 発明の名称

抗炎症剤

2. 特許請求の範囲

(1) シアル酸及びシアル酸誘導体より成る群から選択された一種又は二種以上を含有してなる抗炎症剤

(2) シアル酸誘導体がシアル酸結合オリゴ糖、シアル酸結合タンパク、シアル酸結合脂質並びにシアル酸塩である特許請求の範囲第(1)項記載の抗炎症剤

(3) 乳より抽出して得られるシアル酸又はシアル酸誘導体を用いる特許請求の範囲第(1)項又は第(2)項記載の抗炎症剤

(4) シアル酸がN-アセチルノイラミン酸である特許請求の範囲第(1)項、第(2)項、又は第(3)項記載の抗炎症剤

3. 発明の詳細な説明

(産業上の利用分野)

本発明は新規な抗炎症剤、更に詳しくはシアル

酸塩又はシアル酸誘導体を有効成分とする抗炎症剤に関する。

(従来の技術)

従来から抗炎症剤として広汎に使用されているステロイド、非ステロイド系抗炎症剤は、経口適用するとその多くが副作用として胃痛障害、腎臓障害等をおこすこと、及び外用適用では連続使用による皮膚の非障化、皮膚萎縮、悪作、光悪作、アレルギー等の副作用が知られている。

その対策としてこれまで製剤方法や投与方法の変更及び化合物の構造修飾等が試みられてきたが、満足する結果は得られていない。

(本発明が解決しようとする問題点)

本発明者等は、上記事情に鑑み、安全性が高く、長期適用に耐える抗炎症効果に優れた薬剤を得るべく鋭意研究を重ねた結果、本発明に係るシアル酸並びにシアル酸誘導体が、安全性が高く、且つ長期適用でも副作用の生じない優れた抗炎症効果を有するという事実を見出し、この知見に基づいて本発明を完成するに至った。

(問題点を解決するための手段)

即ち本発明は、シアル酸及びシアル酸誘導体より成る群から選択された一種又は二種以上を含有してなる抗炎剤である。

以下、本発明の構成について記述する。

本発明の用いられるシアル酸は公知の物質であり、ポリヒドロキシモノアミノカルボン酸(ノイラミン酸)のN-アシル及びN-アシル、O-アシル誘導体の総称で、シアリシン酸とも云われる。

シアル酸は、各種の生物に含まれ、通常細胞表層糖質を構成して糖タン白質や糖脂質の末端にグリコシド結合して存在する。特に脳、神経、血液、顎下腺、ムチン質、初乳に多くは存在するが遊離して血清や体液、尿中にも存在する。生物界にいちばん多く見出される代表的なシアル酸はN-アセチルノイラミン酸(NANA:分子重309)で、融点185-187℃、 $[\alpha]_D^{25} -32^\circ \pm 2^\circ$ の白色粉末である。

シアル酸並びにシアル酸誘導体の生物学的薬理作用は細胞表面の陰性荷電への寄与、細胞の特異

な認識機構への関与、ウイルスによる赤血球凝集反応や血液タンパク質のホーミング現象等に関することが知られている。最近では、シアル酸について去膜活性(特開昭61-68418)、抗炎症効果(特開昭62-145015)並びにシアル酸結合オリゴ糖の栄養効果(特開昭61-152233)等の報告がなされている。

しかしながらシアル酸誘導体の抗炎症作用及び皮膚に対する有用性について、又、具体的には、シアル酸及びシアル酸誘導体が皮膚に対して消炎効果(ニキビ、フケ、かみそり負け、日焼け後のほてり等の抑制、創傷治療等)を有すること並びにシアル酸及びシアル酸誘導体の二種以上を含有することによって相乗的抗炎症効果を得ること、更には乳由来シアル酸誘導体は、アラセントエクス由来シアル酸より抗炎症効果に優れることは今知られていない。

シアル酸並びにシアル酸誘導体の製造法は、合成法、天然抽出法(原料:卵白、顎下腺ムチン、胎盤エクス、大腸菌から得られるコロミン酸等)

等が挙げられるが、安価な点から乳原料抽出法(特許第1191212、特許第1253988、特開昭59-184197等)の応用が特に好ましい。

以下に本発明に係る化合物の乳抽出法による製造例を示す。乳抽出法で用いる乳は、牛乳、羊乳、母乳(人)その他、適宜選択できる。又、精製の度合いによりシアル酸含有濃度を自由にコントロールできるので用法、用途、剤型、その他目的に応じて精製すれば良い。尚、製造法はこれにより限定されるものではない。

(製造例1) シアル酸

チーズホエー10gに塩酸28kgを添加してpHを2に調整した後、92℃で60分間加熱して加水分解を行った。得られたホエーの加水分解液をスクリーデカンターを用いて加熱により凝固したタンパク質を除去してシアル酸含有液を得た。次いで、シアル酸含有液を電気透析装置の脱塩槽に入れて伝導度2ms/cmまで脱塩した後、一旦透析を中止して濃縮槽を脱塩した。次いで濃縮槽に蒸留水30ℓを入れて再び伝導度50ms/cmまで透析を行

った。透析終了後、濃縮槽液を濃縮・乾燥して白色粉末600gを得た。このようにして得られた粉末の遊離シアル酸純度は約97%であった。

(製造例2) シアル酸塩

前述の遊離シアル酸を苛性ソーダで調整し、シアル酸Naを得る。この他、目的に応じてK塩、Ca塩、リン酸塩、アミノ酸塩、アミン塩等自由に製造することができる。

(製造例3) シアル酸結合オリゴ糖

牛乳乳又はチーズホエーを限外透過して調整した透液を、全固形20%まで減圧濃縮した。この液25kgを電気伝導度が20ms/cmになる逆電気透析した後、ダウエックス1×2(2kg)を充填したカラムを通じてオリゴ糖を吸着させた。次いで、このカラムに20kgの水を通じて中性塩を除去した後、0.5M塩酸を通じてカラムに吸着したオリゴ糖を溶出させた。得られた溶出液のpHを30%苛性ソーダでpH7.0に調整後、再び電気伝導度が150ms/cmになる逆電気透析した。得られた透析液を濃縮・乾燥して白色粉末100gを得た。このよ

うにして得た粉末のシアル酸結合オリゴ糖純度は90%であった。

(製造例4) シアル酸結合タン白質

レンネットカゼインカード廃液 300gをフードラタンクで75℃・30分間加熱殺菌した後に、40℃まで冷却し、濃塩酸でpHを4.6に調整した。約30分間静置し沈殿を生成させた液をクラリファイヤーに通しpHを7.0に戻した後、清澄液を80℃で濃縮・脱塩した。10倍まで濃縮した後、濃縮液に水を加えて再び10倍まで濃縮した。得られた濃縮液を乾燥して白色粉末1.3kgを得た。このようにして得た粉末のシアル酸結合タン白質の純度は約80%であった。

(製造例5) シアル酸結合脂質

バターミルク粉15kgにクロロホルム-メタノール混液(1:1)を100g加入室温で30分間攪拌し抽出した。次にクロロホルム-メタノール混液を回収しイオン交換樹脂(DEAE-Toyoparl7セー型)1gに通じてシアル酸結合脂質を吸着させ、次いでクロロホルム-メタノール混液(1:

1) 2gで樹脂を洗浄した後、0.5M酢酸ナトリウム-メタノール溶液4gでシアル酸結合脂質を溶出した。溶出液を濃縮しメタノールを除去した後、水5gを加えて限界透過で脱塩とシアル酸結合脂質の濃縮を行った。シアル酸結合脂質を含む濃縮液をエバポレータで乾固した後、シリカゲルカラム(4.0×50cm)に通じシアル酸結合脂質を吸着させ、次いでクロロホルム1g、クロロホルム-メタノール混液(4:1)1gで順次洗浄した後、クロロホルム-メタノール(2:8)の混液2gでシアル酸結合脂質を溶出した。溶出液をエバポレータで蒸発乾固し白色粉末15gを得た。

このようにして得られた粉末のシアル酸結合脂質の純度は薄層クロマトグラフィーで90%以上(レゾルシノール法)であった。

次にシアル酸及びシアル酸誘導体の安全性試験を実施したので、その結果を示す。

急性毒性試験

製造例1～5で製造したシアル酸、シアル酸Na、シアル酸結合オリゴ糖、シアル酸結合タン白、シ

アル酸結合脂質各々を被験物質としてICR系雄性マウス(6週齢、1群5匹)を用い、腹腔内投与は0.5%カルボキシメチルセルロースナトリウム/生理食塩液に各被験物質2重量%となるように懸濁させたものを221/26の注射針を使用し、また経口投与はオリーブ油に各被験物質5重量%となるように懸濁させたものを経口針を使用し、腹腔内投与(60ml/kg)、経口投与(30ml/kg)を与えた。その結果、全部の被験物質について7日間の観察期間中に死亡例、体重の減少および特記すべき中毒症状は認められず、また7日目に行った剖検においても何等異常は認められなかった。

この結果から明らかなように、シアル酸及びシアル酸誘導体の急性毒性値(LD₅₀)は、腹腔内投与で1200mg/kg以上、経口投与で1500mg/kg以上であり、安全性が高いことが判明した。

次に前述で使用した被験物質の薬理試験を実施したのでその結果を示す。

(抗炎症作用試験)

薬物の抗炎症作用を測定するのに一般に用いられているのはカラゲニン足趾浮腫法であり、ヒトにおける抗炎症作用と高い相関関係が認められることから、標準試験法とされている。ウィンター等の方法(Proceedings of the Society for Experimental Biology & Medicine, 111巻、554頁、1962)に従い、ウィスター系雄性ラット(体重110～130g、1群8匹)に0.5%カルボキシメチルセルロース水溶液に懸濁させた被験物質並びにインドメタシンを経口投与(100mg/kg)した。1時間後に起炎物質として1%メーカラゲニン/生理食塩液を当該ラット片側後肢足趾に0.1ml皮下投与して浮腫を惹起させた。起炎物質投与前および投与後の一定時間にそれぞれの足趾体積を測定し、足趾容量の増加率(VI)を求めた。対照群として、被験物質を含有しない0.5%カルボキシメチルセルロース水溶液を投与したラットに同様にメーカラゲニンを注入した際の足趾容量の増加率(V0)を測定し、(V0-VI)×100/V0の計

算式によりカラゲニン浮腫抑制率(%)を算出し、被験物質の抗炎症活性とした。この値が大きい程、抗炎症活性が高いことを示す。メーカラゲニン注入後5時間後の測定値を表-1に示す。

表-1 カラゲニン浮腫抑制試験結果

被験物質	投与量 mg/kg	抑制率
胎盤エキスを由来シアル酸	100	31.0%
乳由来シアル酸	100	38.9%
シアル酸Na塩	100	40.6%
シアル酸結合オリゴ糖	100	39.2%
タン白	100	39.5%
脂質	100	39.8%
シアル酸結合オリゴ糖 シアル酸結合タン白	50 50 計100	45.2%
インドメタシン	100	38.5%

表-1から明らかなように、本発明に係る被験物質はインドメタシンと同様に、強い浮腫抑制率を示し、更には、シアル酸及びシアル酸誘導体より成る群から二種以上を組み合わせて使用することにより相乗的抗炎症作用を有すること、及び胎盤エキスを由来シアル酸に比較し乳由来シアル酸は効果が高いことが判明した。

次にシアル酸並びにシアル酸誘導体を抗炎症剤として適用するための製剤化について述べる。

本発明の抗炎症剤は、シアル酸、シアル酸誘導体の他に製薬上、許容することのできる添加剤及び他の薬剤を加えた混合物の形で使用できる。

但し、安定性の点から、シアル酸は酸、アルカリ、光に対する安定性に問題があり、長期保存には適さないため、安定性の点からシアル酸誘導体として使用することが望ましい。

本発明の抗炎症剤には上記した必須成分の他に通常、化粧品や医薬品等に用いられる他の成分、例えばアボガド油、パーム油、ヒナツツ油、牛脂、コマスカ油、ホホバ油、カルナバウ、ラノ

リン、流動パラフィン、オキシステアリン酸、パルミチン酸イソステアリル、イソステアリルアルコール等の油分、グリセリン、ソルビトール、ポリエチレングリコール、コラーゲン、ヒアルロン酸、コンドロイチン硫酸等の保湿剤、パラジメチルアミノ安息香酸アミル、ウロカニン酸、ジソプロピルケイヒ酸エチル等の紫外線吸収剤、エリソルビン酸ナトリウム、セージエキス、ビタミンE、バラヒドロキシ安息香等の酸化防止剤、ステアリル硫酸ナトリウム、セチル硫酸ジエタノールアミン、セチルトリメチルアンモニウムサッカリン、イソステアリン酸ポリエチレングリコール、アルギニン酸グリセリン等の界面活性剤、エチルパラベン、ブチルパラベン等の防腐剤、オウバク、オウレン、シコン、ジャクヤク、センブリ、バーチ、ビワ等の抽出物、グリチルリチン酸誘導体、グリチルリチン酸誘導体、サリチル酸誘導体、ヒノキチオール、酸化亜鉛、アラントイン等の抗炎症剤、胎盤抽出物、グルタチオン、ユキノシタ抽出物、アスコルビン酸誘導体等の美白剤、ニン

ジン、アロエ、ゼニアオイ、アイリス、ブドウ、ヨクイニン、ヘチマ、ユリ等の抽出物、ローカルゼリー、感光素、コレステロール誘導体、各種アミノ酸類、ビオチン、パントテン酸誘導体等の賦活剤、サフラン、センキュウ、ショウキョウ、オトギリソウ、オノニス、ローズマリー、ニンニク等の抽出物、アロオリザノール、デキストラン硫酸ナトリウム、ビタミンE誘導体、ニコチン酸誘導体等の血行促進剤、萵苣、チアントール等の抗脂漏剤、香料、水、アルコール、カルボキシビニルポリマー等の増粘剤、チタンイエロー、カーサミン、ベニバナ赤等の色料等を必要に応じて適宜配合することができる。

本発明の剤型は、薬効を得るに適したものであれば、任意の形で使用でき、例えば外用剤、粉末、顆粒、散剤、カプセル剤、シロップ剤、坐剤、注射剤等が挙げられる。この中では外用剤が用法上簡便で、予防治療処置の面で好ましく、外用できるものであれば任意の形態でよい。例えば、ローション、リニメント、乳剤等の外用液剤、クリー

ム、軟膏、バスター、パップ、ゼリー、スプレー等の外用半固型剤等を挙げることができ、皮膚に直接塗布又は散布する経皮投与による投与方法をとる。

又、シアル酸並びにシアル酸誘導体の配合濃度及び目的とする効果の度合いにより、医薬品、医薬部外品、化粧品類に利用できる。

本発明の抗炎症剤には、有効成分であるシアル酸及びシアル酸誘導体の一種又は二種以上の配合量は、組成物全重量に対して 0.0001～50重量％、好ましくは 0.001～5重量％である。0.0001重量％未満では、効果が乏しくなる傾向にあり、逆に50重量％を超えて配合しても効果の大きな増大を望むことは難しい。

本発明の抗炎症剤の投与量は、年齢、個人差、病状等によって下記範囲外の量を投与することもあり得るので、明確には規定できないが、一般にシアル酸及びシアル酸誘導体の一種又は二種以上の内服及び経皮投与量は体重1kg及び1日あたり0.001～2,000mg、好ましくは0.01～1,000mgで

あり、この量を1日に1回又は数回に分けて投与することができる。

適応は医薬品用途では消炎鎮痛剤として、急性湿疹、慢性湿疹、アトピー性皮膚炎、接触皮膚炎、帯状疱疹、及び種々の原因による湿疹皮膚炎や各種創傷、火傷、急性慢性関節炎、関節周囲炎、腰痛、筋肉痛等に有効と判断される。

化粧品、医薬部外品用途では、消炎剤としてニキビ、フケ、カサミ、あせも、ただれ、肌あれ、かみそり負け、日焼け等のほてり等に有効と判断される。

以下に本発明の実施例を示し、本発明を具体的に説明する。尚、本発明はこれにより限定されるものではない。

(実使用試験)

試験方法

顔面にニキビ(尋常性ざ瘡)をもつ10代～20代の男女計30名を被験者とし、1群5名の6群に分け、本発明にかかる被験物質含有ローション実施例1～5、及び比較例1としてグリチルリチン酸含有

ローションを1群ずつ使用させた。使用法は、化粧石鹸を用いて顔面をよく洗浄後、皮膚の上にのみ、各試験ローションを1日に1～3回、3週間連続塗布使用させた。

判定

面皰、丘疹、腫瘍の3症状について試験ローションの使用前に比較して、使用後の症状の改善度を5段階(著しく軽快、かなり軽快、やや軽快、不変、悪化)にて評価し、有用性を判断した。

結果

表-3の結果から本発明に係る被験物質がニキビに有効かつ副作用のない安全性の高い抗炎症剤であること、及び同じ被験物質でも、乳由来品の方が、プラセンタ由来品より効果が高いこと並びに、被験物質を二種以上組合せると相乗効果が得られることを認めた。

表-2 実施例1～5及び比較例1の処方

(重量％)

配合成分	実 施 例					比較例1
	1	2	3	4	5	
クエン酸	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1
スルホ石炭酸亜鉛	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
グリセリン	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0	5.0
ポリオキシエチレン(20モル)アルコールエーテル	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0	1.0
エチルアルコール	20.0	20.0	20.0	20.0	20.0	20.0
香料・防腐剤	適量	適量	適量	適量	適量	適量
シアル酸(製造例1)	1.0	—	—	—	—	—
シアル酸結合オリゴ糖(製造例3)	—	1.0	—	—	—	—
シアル酸結合タンパク(製造例4)	—	—	1.0	—	—	—
シアル酸(胎盤エキス由来)	—	—	—	—	1.0	—
グリチルリチン酸	—	—	—	—	—	1.0
精製水	残量	残量	残量	残量	残量	残量

表-3 実使用試験結果

改善度 (人数)	実 施 例					比較 例 1
	1	2	3	4	5	
著しく軽快	2	1	1	2	0	0
かなり軽快	1	2	2	2	1	1
やや軽快	1	1	1	1	2	2
不変	1	1	1	0	2	2
悪化	0	0	0	0	0	0
計 (人数)	5	5	5	5	5	5

次に各種実施態様について例を示す。以下、
配合量は重量%とする。

実施例6 錠剤

シアル酸結合オリゴ糖 100mgと微結晶セルロース 100mgとを含有する錠剤を常法に従って調製し、シロップゼラチン沈降性炭酸カルシウムで糖衣をほどこした。この錠剤は1回の投与量1〜10錠で使用される。

	(重量%)
シアル酸結合オリゴ糖	1.0
セトステアリルアルコール	4.0
流動パラフィン	40.0
ラノリン	7.0
ステアリン酸モノグリセリド	2.2
ポリオキシエチレン (20) ソルビタン モノステアレート	2.8
1,3-ブチレングリコール	6.8
エチルパラベン	0.2
精製水	36.0

実施例11 ローション

次の処方に従い、常法によりローションを製造した。

	(重量%)
シアル酸結合タン白	0.1
グリセリン	4.0
1,3-ブチレングリコール	4.0
エタノール	7.0
ポリオキシエチレンオレイルアルコール	0.5

実施例7 顆粒剤

シアル酸Na20gと乳糖80g、水10g及び微結晶セルロース90gを均一混合し、球砕造粒し、乾燥、篩別して顆粒剤を得た。この顆粒剤は1回の投与量0.5〜10gで使用される。

実施例8 カプセル剤

シアル酸結合タン白 100mg、微結晶セルロース 100mgおよび乳糖 200mgを均一混合。このカプセル剤は1回の投与量1〜10カプセルで使用される。

実施例9 軟膏

流動パラフィン (95%) とポリエチレン (5%) より成るブスチベース 50W、47.5g にシアル酸結合脂質 2.5g を混合し、減圧脱気して 50.0g の軟膏を得た。この軟膏は1日4〜5回患部に塗布する。

実施例10 クリーム

次の処方に従い、常法によりクリームを製造した。

メチルパラベン	0.05
クエン酸	0.01
クエン酸ソーダ	0.1
精製水	84.24
本ローションを日やけ傘、ほてりを生じている女子5名の被験者に2日間、1日数回使用させた結果、ほてりが抑制され、ほてり抑制に対する有用性が認められた。	

実施例12 パスタ剤

次の処方に従い、常法によりパスタ剤を製造した。

	(重量%)
シアル酸結合タン白	20.0
酸化亜鉛	24.0
デンアシン	24.0
白色ワセリン	32.0

実施例13 乳液

次の処方に従い、常法により乳液を製造した。

(重量%)		実施例14 栄養クリーム	
ステアリン酸	2.0	次の処方に従い、常法により栄養クリームを製造した。	
セタノール	1.0	(重量%)	
ワセリン	3.0	ステアリン酸	2.0
ラノリンアルコール	2.0	ステアリンアルコール	7.0
流動パラフィン	8.0	還元ラノリン	2.0
スクワラン	3.0	スクワラン	5.0
エスカロール 507	2.0	オクチルドデカノール	6.0
シアル酸Cα塩	5.0	PGE (25) セチルエーテル	3.0
PGE (10) モノオレート	2.5	グリセリルモノステアレート	2.0
トリエタノールアミン	1.0	プロピレングリコール	5.0
プロピレングリコール	5.0	シアル酸結合オリゴ糖	1.0
防腐剤	適量	シアル酸結合タン白	1.0
香料	適量	香料・防腐剤	適量
蒸留水	残余	蒸留水	残余

かみそり負けに悩む男性5名の被験者に、1か月間かみそり後に本乳液を使用させた所、5名中4名はかみそり負けが起こらなくなり、残り1名にも、改善効果が認められ、本乳液のかみそり負けに対する有用性が認められた。

実施例15 バック

次の処方に従い、常法によりバックを製造した。

(重量%)		香料・酸化防止剤	
カオリン	65.0	適量	
タルク	19.0	ヒマシ油	
プロピレングリコール	15.0	残余	
酢酸カルシウム	0.01		
炭素	0.5		
シアル酸結合脂質	0.01		
香料	0.48		

実施例16 リップトリートメント

常法に従って以下の処方のリップトリートメントを製造した。

(重量%)		香料・酸化防止剤	
キャンドリラロウ	9.0	適量	
固形パラフィン	8.0	ヒマシ油	
ミツロウ	5.0	残余	
カルナバロウ	5.0		
ラノリン	11.0		
シアル酸結合オリゴ糖	0.2		
シアル酸結合タン白	0.2		
イソプロピルミリステート	10.0		

実施例17 ヘアトニック

次の処方に従って、常法によりヘアトニックを製造した。

(重量%)		香料・酸化防止剤	
エタノール	55.0	適量	
ヒノキチオール	0.1	ヒマシ油	
メフェナム酸	0.1	残余	
メントール	0.1		
ニコールHCO-60	1.0		
シャクヤクエキス	0.7		
グリセリン	1.0		
シアル酸リン酸Mg	2.0		
色素・香料	適量		
精製水	残余		

フケ症の男性5名の被験者に、本ヘアトニックを1日2回、1か月間使用させたところ、全員に優れたフケ、カユミを抑制する効果が認められた。

(発明の効果)

本発明の抗炎症剤は、抗炎症効果に優れ、安全性、使用性に優れたものである。更に外用適応の場合、皮膚によく透過し、刺激やホルモン様副作用を全く与えず、皮膚疾患の予防、治療、処置に有効に働くものである。

特許出願人 株式会社 資 生 堂
雪 印 乳 業 株 式 会 社

第1頁の続き

⑤Int.Cl. ⁴	識別記号	庁内整理番号
A 61 K 7/00	ADA	J-7306-4C
7/06		7430-4C
31/195	ABE	7330-4C
37/02		8615-4C